

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2005 年 9 月 22 日 (22.09.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/087762 A1

(51) 国際特許分類: C07D 403/14, A61P 35/00, A61K 31/4178, A61P 43/00, C07D 487/04

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/004250

(22) 国際出願日: 2005 年 3 月 10 日 (10.03.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2004-114793 2004 年 3 月 13 日 (13.03.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): テムリック株式会社 (TMRC CO.,LTD.) [JP/JP]; 〒1070052 東京都港区赤坂 3 丁目 4 番 3 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 杉山 弘 (SUGIYAMA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒6028442 京都府京都市上京区薬師町 2 2 5-9 0 3 Kyoto (JP). 板東 俊和 (BANDO, Toshikazu) [JP/JP]; 〒6068173 京都府京都市左京区一乗寺梅ノ木町 1 1 番地 メゾン西川 2-B Kyoto (JP).

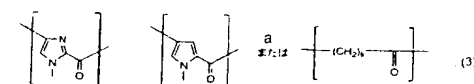
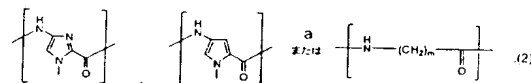
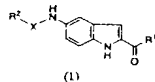
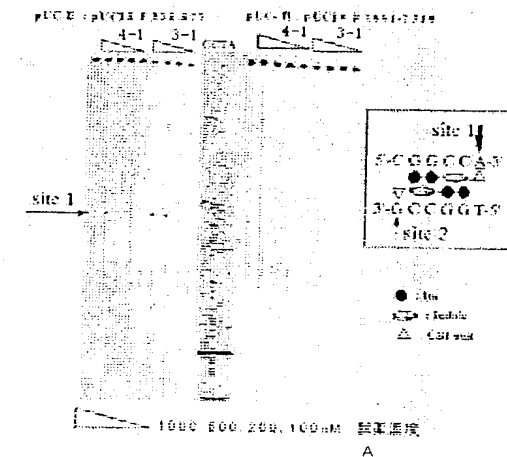
(74) 代理人: 本多 一郎 (HONDA, Ichiro); 〒1010065 東京都千代田区西神田二丁目 5 番 7 号 神田中央ビル 2 階 2 0 1 号室 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,

(続葉有)

(54) Title: NOVEL INDOLE DERIVATIVE FOR ALKYLATING SPECIFIC BASE SEQUENCE OF DNA AND ALKYLATING AGENT AND DRUG EACH COMPRISING THE SAME

(54) 発明の名称: DNA の特定塩基配列をアルキル化する新規インドール誘導体ならびにそれを用いたアルキル化剤および薬剤



A... REAGENT CONCENTRATION  
a... or

(57) Abstract: A novel pyrrole-imidazole polyamide type compound for alkylating a specific base sequence of a DNA. It can be synthesized through fewer reaction steps than conventional hybrid molecules and combines high reactivity in DNA alkylation with the ability to recognize a sequence. Also provided are an alkylating agent and a molecule functioning as a drug which each comprises the compound. The novel compound is an indole derivative represented by the following general formula (1) wherein R<sup>1</sup> represents a functional group alkylating a DNA; R<sup>2</sup> represents hydrogen, alkyl, or acyl; and X represents either a divalent group consisting of one of the structural units represented by the following formulae (2) (wherein m is an integer of 0 to 10) or a divalent group composed of two or more identical or different structural units selected among those structural units, provided that the structural unit present at the R<sup>2</sup>-side end of the structural units may be any of the following formulae (3) (wherein k is an integer of 0 to 10).

(続葉有)

WO 2005/087762 A1



ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

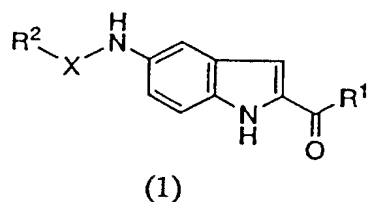
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),

/続葉有/

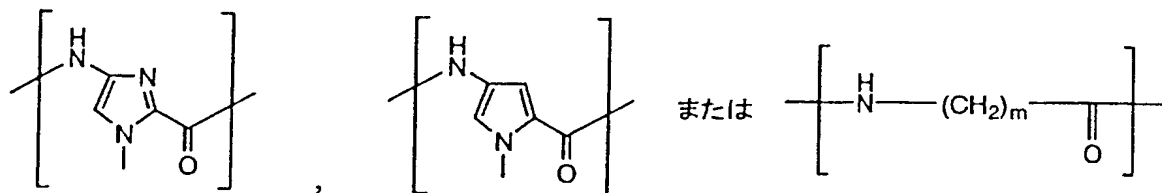
(57) 要約:

従来のハイブリッド分子よりも短い反応ステップで合成でき、かつ、反応性の高いDNAアルキル化能と配列認識能を兼ね備えたDNAの特定塩基配列をアルキル化するピロールイミダゾールポリアミド系の新規化合物ならびにそれを用いたアルキル化剤および薬剤機能分子を提供する。

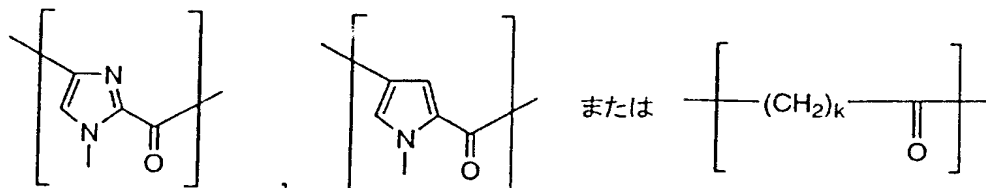
下記一般式(1)、



(式中、 $R^1$ はDNAをアルキル化する官能基、 $R^2$ は水素原子、アルキル基またはアシル基、Xは下記式、



を構成単位 ( $m$ は0-10の整数)とし、該構成単位の一つからなる2価の基、または同一でも異なっているもよい2つ以上の該構成単位からなる2価の基である。但し、前記構成単位のうち、上記 $R^2$ 側末端の構成単位は下記式、



( $k$ は0-10の整数)であつてもよい。)で表わされるインドール誘導体である。



OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

— 電子形式により別個に公開された明細書の配列表部分、請求に基づき国際事務局から入手可能

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。